

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
23. Oktober 2003 (23.10.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2003/087049 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **A61K 31/46**,  
31/343, C07D 451/10

GAU-ALGESHEIM (DE). **SPECK, Georg** [DE/DE]; In  
der Bitz 10, 55218 INGELHEIM AM RHEIN (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/003670

(74) **Gemeinsamer Vertreter: BOEHRINGER INGEL-  
HEIM PHARMA GMBH & CO. KG**; Binger Strasse  
173, 55216 Ingelheim (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:  
9. April 2003 (09.04.2003)

(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO,  
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,  
UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 16 427.4 12. April 2002 (12.04.2002) DE

(71) **Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH  
& CO. KG** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim  
(DE).

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,  
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) **Erfinder; und**

(75) **Erfinder/Anmelder (nur für US): BANHOLZER, Rolf**  
[DE/DE]; Pfullinger Strasse 55, 70597 STUTTGART  
(DE). **MEADE, Christopher, John, Montague** [GB/DE];  
Burgstrasse 104, 55411 BINGEN (DE). **MEISSNER, Hel-  
mut** [DE/DE]; Hallgartenerstrasse 9, 55218 INGELHEIM  
(DE). **MORSCHHÄUSER, Gerd** [DE/DE]; Rissegger  
Steige 97, 88400 BIBERACH (DE). **PAIRET, Michel**  
[FR/DE]; Birkenharderstrasse 6, 88400 BIBERACH  
(DE). **PIEPER, Michael, P.** [DE/DE]; Geschwis-  
ter-Scholl-Strasse 45, 88400 BIBERACH (DE). **POHL,  
Gerald** [DE/DE]; Akazienweg 12, 88400 BIBERACH  
(DE). **REICHL, Richard** [DE/DE]; Im Hippel 55, 55435

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts:** 5. Februar 2004

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-  
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.*

(54) **Title:** PHARMACEUTICAL COMBINATIONS CONTAINING HETEROCYCLIC COMPOUNDS AND A NOVEL ANTI-  
CHOLINERGIC AGENT

(54) **Bezeichnung:** ARZNEIMITTELKOMBINATIONEN ENTHALTEND HETEROCYCLISCHE VERBINDUNGEN UND EIN  
NEUES ANTICHOLINERGIKUM

(57) **Abstract:** The invention relates to novel pharmaceutical compositions based on a novel anticholinergic agent (1) and hetero-  
cyclic compounds (2), to methods for the production thereof, and to the use of the same in the treatment of respiratory tract diseases.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft neuartige Arzneimittelkompositionen auf der Basis einen neuen Anti-  
cholinergikums (1) und heterocyclischer Verbindungen (2), Verfahren zu deren Herstellung sowie deren Verwendung bei der Therapie  
von Atemwegserkrankungen.



WO 2003/087049 A3

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Internat. Application No.

PCT/EP 03/03670

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A61K31/46 A61K31/343 C07D451/10

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 771 794 A (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD) 7 May 1997 (1997-05-07) page 3 -page 5, column 53 & WO 96 36624 A 21 November 1996 (1996-11-21) cited in the application ---	1-28
Y	WO 00 69468 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG) 23 November 2000 (2000-11-23) page 1 -page 8, line 20 ---- -/--	1-28

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*&\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

26 September 2003

Date of mailing of the international search report

09/10/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Kyriakakou, G

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern: Application No

PCT/EP 03/03670

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>RONG XU ET AL.: "Synthesis, Antimuscarinic Activity and quantitative Structure-Activity Relationship(qsar)of tropinyl and piperidinyl Esters" CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN., vol. 46, no. 2, 1998, pages 231-241, XP001071255 PHARMACEUTICAL SOCIETY OF JAPAN. TOKYO., JP ISSN: 0009-2363 the whole document</p> -----	1-28

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern .. . Application No  
PCT/EP 03/03670

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
EP 771794	A	07-05-1997	AU	705690 B2		27-05-1999
			AU	5702996 A		29-11-1996
			EP	0771794 A1		07-05-1997
			NO	970151 A		06-03-1997
			US	2002128290 A1		12-09-2002
			WO	9636624 A1		21-11-1996
<hr/>						
WO 0069468	A	23-11-2000	DE	19921693 A1		16-11-2000
			AT	245976 T		15-08-2003
			AU	4754500 A		05-12-2000
			BG	106095 A		28-06-2002
			BR	0010498 A		26-02-2002
			CA	2368583 A1		23-11-2000
			CN	1350465 T		22-05-2002
			CZ	20014055 A3		13-02-2002
			DE	50003116 D1		04-09-2003
			EE	200100594 A		17-02-2003
			WO	0069468 A1		23-11-2000
			EP	1178832 A1		13-02-2002
			EP	1327452 A2		16-07-2003
			HR	20010828 A1		28-02-2003
			HU	0201103 A2		28-09-2002
			JP	2002544239 T		24-12-2002
			NO	20015359 A		02-11-2001
			SK	16372001 A3		05-03-2002
			TR	200103233 T2		22-04-2002
			US	2002115681 A1		22-08-2002
			US	6455524 B1		24-09-2002
			US	6433027 B1		13-08-2002
			ZA	200108942 A		26-08-2002
<hr/>						

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inter ... des Aktenzeichen

PCT/EP 03/03670

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
 IPK 7 A61K31/46 A61K31/343 C07D451/10

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 771 794 A (KYOWA HAKKO KOGYO CO.,LTD) 7. Mai 1997 (1997-05-07) Seite 3 -Seite 5, Spalte 53 & WO 96 36624 A 21. November 1996 (1996-11-21) in der Anmeldung erwähnt ---	1-28
Y	WO 00 69468 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG) 23. November 2000 (2000-11-23) Seite 1 -Seite 8, Zeile 20 --- -/--	1-28

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

26. September 2003

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

09/10/2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Kyriakakou, G

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	<p>RONG XU ET AL.: "Synthesis, Antimuscarinic Activity and quantitative Structure-Activity Relationship(qsar)of tropinyl and piperidinyl Esters" CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN., Bd. 46, Nr. 2, 1998, Seiten 231-241, XP001071255 PHARMACEUTICAL SOCIETY OF JAPAN. TOKYO., JP ISSN: 0009-2363 das ganze Dokument</p> <p>-----</p>	1-28

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern. Aktenzeichen

PCT/EP 03/03670

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 771794 A	07-05-1997	AU 705690 B2	27-05-1999
		AU 5702996 A	29-11-1996
		EP 0771794 A1	07-05-1997
		NO 970151 A	06-03-1997
		US 2002128290 A1	12-09-2002
		WO 9636624 A1	21-11-1996
WO 0069468 A	23-11-2000	DE 19921693 A1	16-11-2000
		AT 245976 T	15-08-2003
		AU 4754500 A	05-12-2000
		BG 106095 A	28-06-2002
		BR 0010498 A	26-02-2002
		CA 2368583 A1	23-11-2000
		CN 1350465 T	22-05-2002
		CZ 20014055 A3	13-02-2002
		DE 50003116 D1	04-09-2003
		EE 200100594 A	17-02-2003
		WO 0069468 A1	23-11-2000
		EP 1178832 A1	13-02-2002
		EP 1327452 A2	16-07-2003
		HR 20010828 A1	28-02-2003
		HU 0201103 A2	28-09-2002
		JP 2002544239 T	24-12-2002
		NO 20015359 A	02-11-2001
		SK 16372001 A3	05-03-2002
		TR 200103233 T2	22-04-2002
		US 2002115681 A1	22-08-2002
		US 6455524 B1	24-09-2002
		US 6433027 B1	13-08-2002
		ZA 200108942 A	26-08-2002